

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
1. März 2001 (01.03.2001)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 01/14332 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 211/18,
409/06, 405/06, 417/06, 401/06, A61K 31/445, 31/4523,
A61P 25/00, 25/16, 25/18

64342 Seeheim-Jugenheim (DE). VAN AMSTERDAM,
Christoph [DE/DE]; Schepp Allee 47, 64295 Darmstadt
(DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP00/07664

(74) Gemeinsamer Vertreter: MERCK PATENT GMBH;
Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt (DE).

(22) Internationales Anmeldedatum:
8. August 2000 (08.08.2000)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
199 39 756.2 21. August 1999 (21.08.1999) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von
US): MERCK PATENT GMBH [DE/DE]; Frankfurter
Strasse 250, 64293 Darmstadt (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): PRÜCHER, Hel-
mut [DE/DE]; Königsbergerstrasse 9, 64646 Hep-
penheim (DE). BÖTTCHER, Henning [DE/DE];
Theodor-Heuss-Strasse 13, 64287 Darmstadt (DE). ACK-
ERMANN, Karl-August [DE/DE]; Am Pfarrweiher
40, 64372 Ober-Ramstadt (DE). GOTTSCHLICH,
Rudolf [DE/DE]; Buchenweg 1, 64354 Reinheim (DE).
GREINER, Hartmut [DE/DE]; Kreuzstrasse 54, 64331
Weiterstadt (DE). HARTING, Jürgen [DE/DE]; Rod-
inghweg 15, 64287 Darmstadt (DE). BARTOSZYK,
Gerd [DE/DE]; Kreuzstrasse 57, 64331 Weiterstadt (DE).
SEYFRIED, Christoph [DE/DE]; Mathildenstrasse 6,

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AL, AM, AT, AU,
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE,
DK, DM, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID,
IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT,
LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL,
PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ,
UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eura-
sisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),
europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI,
FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI-Patent
(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE,
SN, TD, TG).

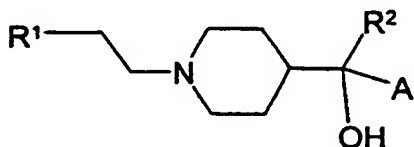
Veröffentlicht:

- Mit internationalem Recherchenbericht.
- Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden
Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen
eintreffen.

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes, und der anderen
Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on
Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe
der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: PIPERIDINE ALCOHOLS

(54) Bezeichnung: PIPERIDINALKOHOLE



(1)

disorders, (OCD).

(57) Zusammenfassung: Verbindungen der Formel (I), worin R¹, R² und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen besit-
zen, sind potente 5-HT_{2A}-Antagonisten und eignen sich zur Behandlung von Psychosen, Schizophrenie, Depression, neurologi-
schen Störungen, Gedächtnisstörungen, Morbus Parkinson, amyotropher Lateralsklerose, der Alzheimer Krankheit, der Huntington
Krankheit, Essstörungen wie Bulimie, nervöser Anorexie, des prämenstrualen Syndroms und/oder zur positiven Beeinflussung von
Zwangsverhalten (obsessive-compulsive disorder, OCD).

(57) Abstract: The invention relates to compounds of formula
(I), wherein R¹, R² and A have the meanings given in claim 1,
are potent 5-HT_{2A} antagonists and are suitable for treating psy-
choses, schizophrenia, depression, neurological disorders, im-
paired memory, Parkinson's disease, amyotrophic lateral scler-
osis, Alzheimer's disease, Huntington's disease, eating disor-
ders such as bulimia and anorexia nervosa, Pre-Menstrual Syn-
drome and/or for positively influencing obsessive-compulsive

WO 01/14332 A1